



①9 BUNDESREPUBLIK  
DEUTSCHLAND



DEUTSCHES  
PATENTAMT

①2 Offenlegungsschrift  
①0 DE 40 03 587 A 1

②1 Aktenzeichen: P 40 03 587.5  
②2 Anmeldetag: 7. 2. 90  
④3 Offenlegungstag: 8. 8. 91

⑤1 Int. Cl. 5:  
**C 07 D 471/04**  
C 07 D 498/04  
C 07 D 215/38  
A 01 N 43/90  
// (C07D 471/04,  
221:00,235:00) (C07D  
498/04,221:00,  
263:00)C07D 215/40  
(A01N 43/90,43:60,  
43:86,33:18,47:10,  
43:66,37:18, 47:28,  
31:08,43:08,35:06,  
43:40,39:02,43:54)

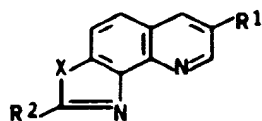
DE 40 03 587 A 1

⑦1 Anmelder:  
BASF AG, 6700 Ludwigshafen, DE

⑦2 Erfinder:  
Brill, Gunter, Dr., 6733 Hassloch, DE; Hagen, Helmut,  
Dr., 6710 Frankenthal, DE; Wuerzer, Bruno, Dr., 6701  
Otterstadt, DE; Westphalen, Karl-Otto, Dr., 6720  
Speyer, DE

⑤4 3H-Imidazo[4,5-h](Oxazolo[5,4-h])chinoline, Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses

⑤7 Die Erfindung betrifft 3H-Imidazo[4,5-h](Oxazo-  
lo[5,4-h])chinoline der Formel



in der

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Halogen, Carboxyl oder gegebenenfalls substituiertes Alkyl,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, Alkoxy, Alkylthio, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, gegebenenfalls substituiertes Cycloalkyl, einen gegebenenfalls substituierten Benzyl-, Phenethyl-, Phenyl- oder Naphthylrest oder einen gegebenenfalls substituierten 5- oder 6gliedrigen heterocyclischen Ring mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff und

X für Sauerstoff oder den Rest N-R<sup>3</sup>, wobei R<sup>3</sup> Wasserstoff, gegebenenfalls substituiertes Alkyl, Alkenyl, Alkynyl, Cycloalkyl oder gegebenenfalls substituiertes Benzyl bedeutet, stehen,

Verfahren zu ihrer Herstellung und ihre Verwendung zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses.

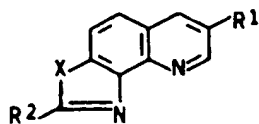
DE 40 03 587 A 1

## Beschreibung

Die Erfindung betrifft 3H-Imidazo[4,5-h](Oxazo[5,4-h])chinoline, Verfahren zur ihrer Herstellung, Herbizide, die diese Verbindungen als Wirkstoffe enthalten, sowie ein Verfahren zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses mit diesen Wirkstoffen.

Substituierte 3H-Imidazo[4,5-h](Oxazo[5,4-h])chinoline wurden bereits beschrieben (J. Fluorine Chem. Bd. 20, S. 573—580 (1982); *ibid.* Bd. 41, S. 277—288 (1988)); derartige Verbindungen mit herbiziden Eigenschaften sind allerdings nicht bekannt.

Es wurde nun gefunden, daß 3H-Imidazo[4,5-h](Oxazo[5,4-h])chinoline der Formel



(I),

in der

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Halogen, Carboxyl oder gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkylthio oder Halogen substituiertes C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>-Alkyl,

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkylthio, einen gegebenenfalls mit Halogen, Hydroxy, Acetoxy, Cyano, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkylthio substituierten C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>-Alkylrest, einen gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>-Cycloalkylrest, einen gegebenenfalls durch Nitro, Amino, Halogen, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Acylamino oder Acyloxy substituierten Benzyl-, Phenethyl-, Phenyl- oder Naphthylrest oder einen gegebenenfalls durch Nitro, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen substituierten 5- oder 6-gliedrigen heterocyclischen Ring mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff und

X für Sauerstoff oder den Rest N—R<sup>3</sup>, wobei R<sup>3</sup> Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen, Amino, Mono- oder Dialkylamino, Hydroxy, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkylalcoxy substituiertes C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>-Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Benzyl bedeutet,

stehen, herbizide Wirkung haben und gegenüber Kulturpflanzen selektiv sind.

Die C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>-Alkylreste für R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> in Formel I können unverzweigt oder verzweigt sein und beispielsweise Methyl, Ethyl, n-Propyl, i-Propyl, n-Butyl, i-Butyl, s-Butyl, n-Pentyl oder n-Hexyl bedeuten. Entsprechendes gilt für Alkoxy-, Alkylthio-, Halogenalkyl-, Alkylamino-, Alkylhydroxy-, Alkylalkoxy- und Alkylacyloxyreste. Geeignete Substituenten der Alkylreste für R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> sind Halogen, wie Chlor, Brom oder Fluor, Hydroxy, wie Hydroxymethyl oder 1-Hydroxyethyl, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkylthio, wie Methoxy, Ethoxy, Methylthio oder Ethylthio. Beispiele für solche Reste sind Trichlormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl, Chlormethyl, Methoxymethyl, 1-Methoxyethyl, Methylthiomethyl, Ethylthiomethyl. Bevorzugt sind Reste mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen.

Halogen in Substituenten der Formel I bedeutet beispielsweise Fluor, Chlor oder Brom.

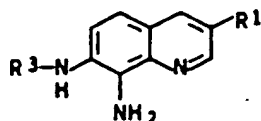
Beispiele für C<sub>3</sub>—C<sub>6</sub>-Cycloalkylreste für R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup> sind Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl und Cyclohexyl. Die Reste für R<sup>2</sup> können zusätzlich durch C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkyl, insbesondere Methyl oder Ethyl, substituiert sein.

Die Benzyl-, 1-Phenethyl-, 2-Phenethyl-, Phenyl-, 1-Naphthyl- und 2-Naphthylreste für R<sup>2</sup> können einfach oder mehrfach substituiert sein. Beispiele für Substituenten sind Nitro, Amino, Halogen, wie Fluor, Chlor, Brom, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkyl, vorzugsweise Methoxy oder Ethoxy, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkylthio, vorzugsweise Methylthio, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, wie Trifluormethyl, Acylamino mit 1 bis 4 C-Atomen in der Acylgruppe, beispielsweise Formyl, Acetyl, Propionyl, n-Butyryl oder i-Butyryl und Acyloxy mit 2 bis 5 C-Atomen in der Acylgruppe, beispielsweise Acetyloxy, Propionyloxy, n-Butyryloxy oder i-Butyryloxy.

Beispiele für heterocyclische Reste für R<sup>2</sup> sind Pyrrolyl, Furyl, Thienyl, Thiazolyl, Isothiazolyl, Oxazolyl, Isooxazolyl, Pyrazolyl, Imidazolyl, Pyridyl, Pyrimidyl, Pyrazinyl, Pyridazinyl. Diese Reste können durch Nitro, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkyl, vorzugsweise Methyl oder Ethyl, oder durch Halogen, wie Chlor, Brom oder Fluor, substituiert sein.

R<sup>3</sup> im Rest -NR<sup>3</sup> steht für Wasserstoff, C<sub>1</sub>—C<sub>6</sub>-Alkyl, vorzugsweise C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkyl, insbesondere Methyl oder Ethyl, C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>-Alkenyl, insbesondere Vinyl oder Allyl, C<sub>2</sub>—C<sub>6</sub>-Alkynyl, insbesondere Propargyl, einen gegebenenfalls durch Halogen, Amino, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Mono- oder C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Dialkylamino, Hydroxy-, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkoxy- oder C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkylalcoxy substituierten C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkylrest, beispielsweise 2-Chlorethyl, 3-Chlor-n-propyl, 2-Aminoethyl, 2-Methylaminoethyl, 2-Dimethylaminoethyl, 2-Hydroxyethyl, 3-Acetoxypropyl oder 2-Methoxypropyl oder einen gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>—C<sub>4</sub>-Alkoxy substituierten Benzylrest bedeuten, beispielsweise 4-Chlor-benzyl, 4-Trifluormethyl-benzyl, 4-Methyl-benzyl, 4-Methoxy-benzyl oder 2,4-Dichlor-benzyl.

Man erhält die 3H-Imidazo[4,5-h]chinoline der Formel I durch Umsetzung von 7,8-Diamino-chinolin der Formel



(II)

in an sich bekannter Weise mit Carbonsäuren der Formel



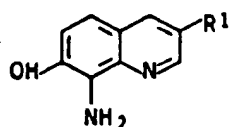
oder Orthoestern der Formel



in der  $R^4$   $C_1-C_4$ -Alkyl bedeutet.

Die Umsetzung verläuft sehr gut bei einer Temperatur im Bereich von 80 bis 120°C in Anwesenheit von Polyphosphorsäure, bei 80 bis 95°C in Salzsäure unterschiedlicher Konzentration oder bei 70 bis 100°C unter Wirkung von 3 bis 6 Äquivalenten IV. Die Menge an III beträgt zweckmäßigerweise 1,1 Mol, bezogen auf 1 Mol II. Größere Überschüsse an III stören nicht.

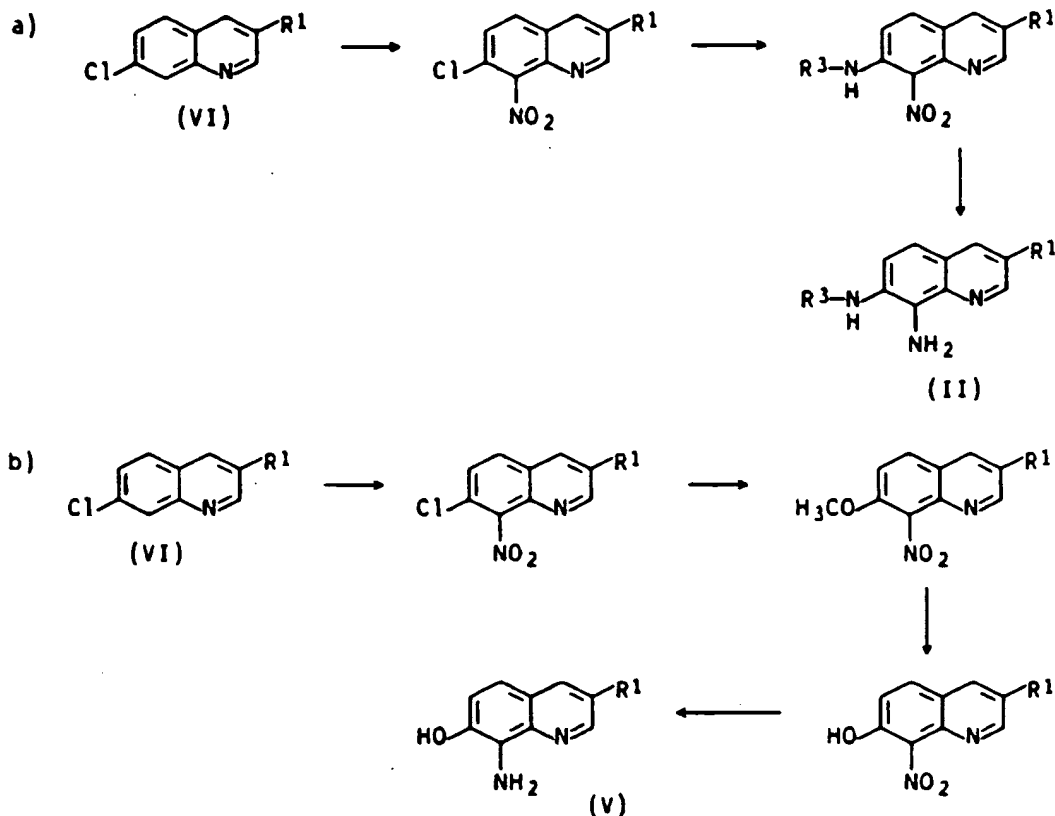
Die Oxazolo[5,4-h]chinoline der Formel I erhält man entsprechend den 3H-Imidazo[4,5-h]chinolinen durch Umsetzung von 7-Hydroxy-8-amino-chinolinen der Formel



(V)

mit Carbonsäuren der Formel III oder Orthoestern der Formel IV. Die für die Synthese der 3H-Imidazo[4,5-h]chinoline angegebenen Reaktionsbedingungen gelten entsprechend.

Die Diaminochinolone II bzw. die Aminohydroxychinoline V können, ausgehend von 7-Chlorchinolinen der Formel VI, in der  $R^1$  die für Formel I genannten Bedeutungen hat, leicht erhalten werden. Die Synthese verläuft in an sich bekannter Weise gemäß folgendem Reaktionsschema:



Synthesebeispiele

Beispiel 1

3-Methyl-7-chlor-3H-imidazo[4,5-h]chinolin

24,9 g (0,12 mol) 8-Amino-3-chlor-7-methylaminochinolin werden mit 107 g (0,72 mol) Triethylorthoformiat versetzt und 30 min auf 100°C erhitzt. Man läßt anschließend successiv auf 0°C abkühlen und saugt den Niederschlag (32 g) ab. Die Mutterlauge wird im Vakuum eingeeengt und der Rückstand aus einer Essigester/Pe-

trolether-Mischung umkristallisiert. Die so erhaltenen vereinten Feststoffe sind identisch.

Ausbeute: 48,5 g (82%);  
Fp.: 188 bis 189°C.

5

## Beispiel 2

## 2-Methyl-3-ethyl-7-chlor-3H-imidazo[4,5-h]chinolin

10 14 g (64 mmol) 8-Amino-3-chlor-7-ethylaminochinolin werden mit 42 g (0,26 mol) Triethylorthoacetat versetzt und 1 Stunde bei 100°C gerührt. Man läßt auf Raumtemperatur kommen, evaporiert überschüssigen Orthoester und kristallisiert den Rückstand aus Essigester um.

Ausbeute: 7,7 g (49%);  
15 Fp.: 145 bis 148°C.

## Beispiel 3

## 2-(4-Chlorphenyl)-3-ethyl-7-chlor-3H-imidazo[4,5-h]chinolin

20

Ein Gemisch bestehend aus 4,1 g (20 mmol) 8-Amino-3-chlor-7-ethylaminochinolin, 3,1 g (20 mmol) 4-Chlorbenzoesäure und 20 ml Polyphosphorsäure wird 1 Stunde auf 120°C erhitzt. Man läßt auf 90°C abkühlen und gibt langsam 100 g Eis in die Lösung. Danach gießt man auf 200 g Eis und stellt mit konzentrierter Natronlauge einen pH-Wert von 12 ein. Man saugt den Niederschlag ab, wäscht gründlich mit warmen Wasser nach, trocknet bei 70°C im Vakuum und kristallisiert aus Essigester um.

Ausbeute: 5,5 g (80%);  
Fp.: 110 bis 112°C.

30

## Beispiel 4

## 2,7-Dimethyloxazolo[5,4-h]chinolin

35 3,48 g (20 mmol) 8-Amino-7-hydroxy-3-methylchinolin werden mit 16,2 g (100 mmol) ortho-Essigsäuretriethyl-ester versetzt und 1 Stunde auf 100°C erwärmt. Man läßt anschließend auf Raumtemperatur abkühlen, versetzt das Reaktionsgemisch unter gutem Rühren mit 50 ml Petrolether und saugt den Niederschlag ab.

Ausbeute: 3,05 g (77%);  
Schmp.: 132 bis 134°C.

40

## Beispiel 5

## 2-(4-Chlorphenyl)-7-chloroxazolo[5,4-h]chinolin

45 Ein Gemisch bestehend aus 3,89 g (20 mmol) 8-Amino-3-chlor-7-hydroxy-chinolin, 3,44 g (22 mmol) 4-Chlorbenzoesäure und 20 ml Polyphosphorsäure wird 2 Stunden auf 120°C erhitzt. Man läßt auf 90°C abkühlen, addiert vorsichtig 100 g Eis und 500 ml Wasser. Die so erhaltene Suspension wird mit konzentrierter Natronlauge auf pH 12 gestellt, der Niederschlag wird abgesaugt, mit Wasser gründlich salzfrei gewaschen und im Vakuum bei 60°C getrocknet. Nach dem Umkristallisieren aus Essigester verbleiben 3,2 g (51%); Schmp.: > 250°C.

50

## Beispiel 6

## 3,7-Dimethyl-2-trifluormethyl-3H-imidazo[4,5-h]chinolin

55 Ein Gemisch bestehend aus 5,61 g (30 mmol) 8-Amino-3-methyl-7-methylaminochinolin und 3,02 ml (40 mmol) Trifluoressigsäure in 40 ml einer 4N Salzsäure wird 2 h auf 95°C erwärmt. Man läßt anschließend auf Raumtemperatur abkühlen, gießt auf 250 g Eis, stellt mit konz. Natronlauge auf pH 9 und saugt den Niederschlag ab. Man trocknet das Rohprodukt und kristallisiert aus Essigester/Petrolether um.

60 Ausbeute: 4,8 g (63%);  
Schmp.: 233–235°C.

## Beispiel 7

## 3-Ethyl-2-hydroxyimidazo[4,5-h]chinolin

65

22,4 g (0,12 mol) 8-Amino-7-ethylaminochinolin werden mit 9 g (0,15 Mol) Harnstoff vermischt und unter gutem Rühren 2 h auf 160°C erhitzt. Man läßt auf 140°C abkühlen und tropft langsam 50 ml Wasser hinzu. Nach

weiterem Abkühlen auf 100°C addiert man nochmals 100 ml Wasser. Der Niederschlag wird abgesaugt, nochmals mit heißem Wasser nachgewaschen und im Vakuum getrocknet.

Ausbeute: 21,6 g (85%);  
Schmp.: > 250°C.

5

#### Beispiel 8

##### 2,7-Dichlor-3-methylimidazo[4,5-h]chinolin

7 g (30 mmol) 7-Chlor-2-hydroxy-3-methylimidazo[4,5-h]chinolin werden mit 7 g (33,6 mmol) Phosphor-pentachlorid und 35 ml (0,38 mol) Phosphoroxotrichlorid versetzt. Man refluxiert das Gemisch 15 h, läßt danach auf Raumtemperatur abkühlen, gießt auf 500 g Eis, stellt mit konz. Natronlauge einen neutralen pH-Wert ein und saugt vom ausgefallenen Niederschlag ab. Nach dem Trocknen und Umkristallisieren aus Ethanol erhält man 2,8 g (37%) Produkt; Schmp.: 211 bis 213°C.

10

Die in den Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften eignen sich unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen der Formel I. Beispiele für solche Verbindungen sind in den folgenden Tabellen aufgeführt. Sie lassen aufgrund ihrer nahen strukturellen Beziehungen zu den in den Synthesebeispielen genannten Verbindungen eine gleichartige Wirkung erwarten.

15

20

25

30

35

40

45

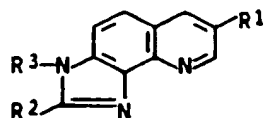
50

55

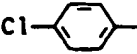


60

65

Tabelle 1



Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Fp [°C]
9	H	H	CH <sub>3</sub>	135 - 137
10	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	238 - 239
11	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	173 - 174
12	H	Cyclopropyl	CH <sub>3</sub>	-
13	H		CH <sub>3</sub>	209 - 211
14	H		CH <sub>3</sub>	-
15	H		CH <sub>3</sub>	205 - 207
16	H	CH <sub>2</sub> -OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	112 - 114
17	H	CH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	78 - 80
18	H	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	78 - 80
19	H	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	199 - 201
20	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	182 - 184
21	H	OH	CH <sub>3</sub>	> 250
22	H	Cl	CH <sub>3</sub>	-
23	H	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	150 - 153
24	H	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	58 - 61
25	H	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	80 - 82

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Fp [°C]
26	H	CF <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	174 - 177
7	H	OH	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	> 250
27	H	Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-
28	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	109 - 111
29	H	CH <sub>3</sub> OCH <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Öl
30	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	190 - 192
31	H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	105 - 108
32	H	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	145 - 146
33	H	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	210 - 212
34	H	CH <sub>3</sub>	Cyclopropyl	224 - 226
35	H	CF <sub>3</sub>	Cyclopropyl	-
36	CH <sub>3</sub>	H	H	-
37	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	-
38	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	92 - 95
39	CH <sub>3</sub>		H	-
40	CH <sub>3</sub>		H	152 - 153
41	CH <sub>3</sub>		H	-
42	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	173 - 175
6	CH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	233 - 235
43	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	213 - 216

5

10

15

20

25

30

35

40



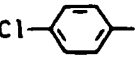
45

50

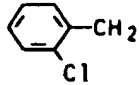
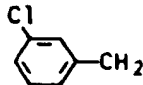

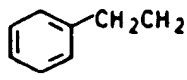
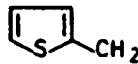
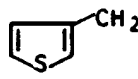
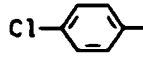
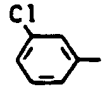

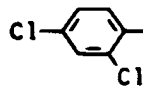
55

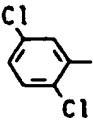
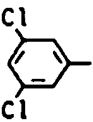
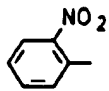
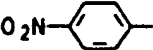



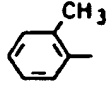

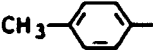


60



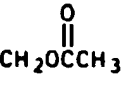
65

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Fp [°C]
44	CH <sub>3</sub>	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	132 - 133
45	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	114 - 118
46	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	159 - 161
47	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	149 - 150
48	Cl	H	H	-
49	Cl	CH <sub>3</sub>	H	273 - 275
50	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	H	215
51	Cl		H	180 - 182
52	Cl		H	118 - 121
53	Cl		H	116 - 119
54	Cl	CF <sub>3</sub>	H	234 - 239
1	Cl	H	CH <sub>3</sub>	188 - 189
55	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	167
56	Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	98 - 101
57	Cl	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	129
58	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	142 - 144
59	Cl	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	113
60	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	126 - 128
61	Cl	(CH <sub>2</sub> ) <sub>5</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	128
62	Cl	Cyclopropyl	CH <sub>3</sub>	48 - 50



Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Fp [°C]
63	Cl	Cyclobutyl	CH <sub>3</sub>	143 - 145
64	Cl	2-Methylcyclopropyl	CH <sub>3</sub>	174 - 177
65	Cl	Cyclopentyl	CH <sub>3</sub>	142 - 144
66	Cl	Benzyl	CH <sub>3</sub>	194 - 196
67	Cl		CH <sub>3</sub>	209 - 211
68	Cl		CH <sub>3</sub>	161 - 163
69	Cl		CH <sub>3</sub>	170 - 173
70	Cl		CH <sub>3</sub>	170 - 173
71	Cl		CH <sub>3</sub>	-
72	Cl		CH <sub>3</sub>	-
73	Cl		CH <sub>3</sub>	170 - 172
74	Cl		CH <sub>3</sub>	165 - 168
75	Cl		CH <sub>3</sub>	231 - 232
76	Cl		CH <sub>3</sub>	> 250

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Fp [°C]
77	Cl		CH <sub>3</sub>	238 - 240
78	Cl		CH <sub>3</sub>	170 - 172
79	Cl		CH <sub>3</sub>	-
80	Cl		CH <sub>3</sub>	-
81	Cl		CH <sub>3</sub>	-
82	Cl		CH <sub>3</sub>	177 - 179
83	Cl		CH <sub>3</sub>	216 - 217
84	Cl		CH <sub>3</sub>	-
85	Cl		CH <sub>3</sub>	196 - 198
86	Cl		CH <sub>3</sub>	190 - 191
87	Cl		CH <sub>3</sub>	-
88	Cl		CH <sub>3</sub>	165

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Fp [°C]
89	Cl		CH <sub>3</sub>	95 - 96
90	Cl		CH <sub>3</sub>	204 - 205
91	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	138 - 140
92	Cl	CH <sub>2</sub> OC <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	237 - 240
93	Cl	CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	145 - 148
94	Cl	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	> 250
95	Cl	CH <sub>2</sub> CN	CH <sub>3</sub>	-
96	Cl		CH <sub>3</sub>	-
97	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )OH	CH <sub>3</sub>	65 - 66
98	Cl	CH(CH <sub>3</sub> )OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	132 - 135
99	Cl	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	215 - 216
100	Cl	CHCl <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	110 - 115
101	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	173 - 175
102	Cl	CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	247 - 250
103	Cl	SH	CH <sub>3</sub>	> 250
8	Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	210 - 213
104	Cl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	-
105	Cl	CF <sub>3</sub>	CH=CH <sub>2</sub>	-
2	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	215 - 217
106	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	145 - 148
107	Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	138 - 140

5

10

15

20

25

30

35

40


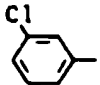
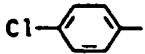

45

50

55

60

65

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Fp [°C]
108	Cl	CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	127 - 130
109	Cl	Cyclopropyl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	146 - 148
110	Cl	CH <sub>2</sub> Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	> 250
111	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	72 - 74
112	Cl	CF <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	140 - 143
113	Cl	OH	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	> 250
114	Cl	Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	-
115	Cl		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	198
116	Cl		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	155 - 156
3	Cl		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	110 - 112
117	Cl		C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	112 - 114
118	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	96 - 98
119	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	128 - 130
120	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	142 - 144
121	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	178 - 181
122	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> -CH=CH <sub>2</sub>	138 - 140
123	Cl	H	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	111 - 113
124	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	123 - 125
125	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	152 - 155

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Fp [°C]
126	Cl	H	Benzyl	163
127	Cl	CH <sub>3</sub>	Benzyl	-
128	Cl	H	Cyclopropyl	130 - 132
129	Cl	CH <sub>3</sub>	Cyclopropyl	229 - 231
130	Cl	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cyclopropyl	-
131	Cl	CHF <sub>2</sub>	Cyclopropyl	180 - 183
132	Cl	CF <sub>3</sub>	Cyclopropyl	-
133	Cl	H	Cyclopentyl	-
134	Cl	CH <sub>3</sub>	Cyclopentyl	167 - 170
135	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	245 - 247
136	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	> 250
137	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	243 - 245
138	Cl	OH	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	227 - 229
139	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC(=O)CH <sub>3</sub>	Harz
140	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )OH	190 - 192
141	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )OH	197 - 200
142	Cl	OH	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )OH	232 - 233
143	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )OC(=O)CH <sub>3</sub>	Harz
144	Cl	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	159 - 162
145	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	150 - 153
146	Cl	OH	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OH	> 250
147	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OC(=O)CH <sub>3</sub>	149 - 151

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

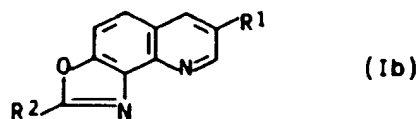
55


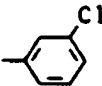
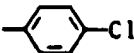

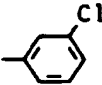
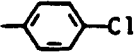
60

65

Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	Fp [°C]
148	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	172 - 174
149	Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> )Cl	161 - 162
150	Cl	OH	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	213 - 215

Tabelle 2



Nr.	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	Fp [°C]
151	H	CH <sub>3</sub>	155 - 156
152	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	92 - 93
153	Cl	H	138
154	Cl	CH <sub>3</sub>	162 - 164
155	Cl		164
156	Cl		232
5	Cl		> 250
157	CH <sub>3</sub>	H	115 - 117
4	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	132 - 134
158	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	79 - 80
159	CH <sub>3</sub>		144 - 146
160	CH <sub>3</sub>		130 - 131
161	CH <sub>3</sub>		243 - 245

Die 3H-Imidazo[4,5-h](Oxazolo[5,4-h])chinoline I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall mög-

lichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Die Verbindungen I eignen sich allgemein zur Herstellung von direkt versprühbaren Lösungen, Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen kommen Mineralölfractionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z. B. Toluol, Xylol, Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron oder stark polare Lösungsmittel, wie N,N-Dimethylformamid, Dimethylsulfoxid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Dispersionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispersiblen Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitete werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z. B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutyl-naphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Lauryl- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanole, sowie von Fettalkoholglykoether, Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenol-, Tributylphenylpolyglykoether, Alkylarylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether oder Polyoxypropylen, Laurylalkoholpolyglykoetheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z. B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoff und pflanzliche Produkte, wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten zwischen 0,1 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,5 und 90 Gew.-%, Wirkstoff.

Beispiele für Formulierungen sind:

I. Man vermischt 90 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 82 mit 10 Gewichtsteilen N-Methyl- $\alpha$ -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinster Tropfen geeignet ist.

II. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 35 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Xylol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

III. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 36 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

IV. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 49 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraction vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

V. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 35 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutyl-naphthalin- $\alpha$ -sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ab-lauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigen Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritz-brühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

VI. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 37 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

VII. 30 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 58 werden mit einer Mischung aus 92 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel und 8 Gewichtsteilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kieselsäuregels gesprüht wurde, innig vermischt. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit.

VIII. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 52 werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykoether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.



Die Applikation kann im Vorauf- oder im Nachaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadien 0,001 bis 4, vorzugsweise 0,01 bis 2 kg/ha.

Zur Verbreitung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die Verbindungen I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner Diazine, 4H-3,1-Benzoxazinderivate, Benzothiazinone, 2,6-Dinitroaniline, N-Phenylcarbamate, Thiocarbamate, Halogencarbonsäuren, Triazine, Amide, Harnstoffe, Diphentylether, Triazinone, Uracile, Benzofuranderivate, Cyclohexan-1,3-dionderivate, Chinolincarbonsäurederivate, Phenoxy- bzw. Heteroaryloxy-phenoxypropionsäuren sowie deren Salze, Ester und Amide und andere in Betracht.

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrationen zugesetzt werden.

In Anbetracht der Vielseitigkeit der Applikationsmethoden können die erfindungsgemäßen Verbindungen bzw. sie enthaltende Mittel noch in einer großen Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Botanischer Name	Deutscher Name	
<i>Allium cepa</i>	Küchenzwiebel	25
<i>Ananas comosus</i>	Ananas	
<i>Arachis hypogaea</i>	Erdnuß	
<i>Asparagus officinalis</i>	Spargel	
<i>Avena sativa</i>	Hafer	30
<i>Beta vulgaris</i> spp. altissima	Zuckerrübe	
<i>Beta vulgaris</i> spp. rapa	Futtermübe	
<i>Beta vulgaris</i> spp. esculenta	Rote Rübe	
<i>Brassica napus</i> var. napus	Raps	35
<i>Brassica napus</i> var. napobrassica	Kohlrübe	
<i>Brassica napus</i> var. rapa	Weißer Rübe	
<i>Brassica rapa</i> var. silvestris	Rüben	
<i>Camellia sinensis</i>	Teestrauch	
<i>Carthamus tinctorius</i>	Saffor — Färberdistel	40
<i>Carya illinoensis</i>	Pekannußbaum	
<i>Citrus limon</i>	Zitrone	
<i>Citrus maxima</i>	Pampelmuse	
<i>Citrus reticulata</i>	Mandarine	45
<i>Citrus sinensis</i>	Apfelsine, Orange	
<i>Coffea arabica</i> ( <i>Coffea canephora</i> , <i>Coffea liberica</i> )	Kaffee	
<i>Cucumis melo</i>	Melone	
<i>Cucumis sativus</i>	Gurke	
<i>Cynodon dactylon</i>	Bermudagrass	50
<i>Daucus carota</i>	Möhre	
<i>Elaeis guineensis</i>	Ölpalme	
<i>Fragaria vesca</i>	Erdbeere	
<i>Glycine max</i>	Sojabohne	55
<i>Gossypium hirsutum</i> ( <i>Gossypium arboreum</i> , <i>Gossypium herbaceum</i> , <i>Gossypium vitifolium</i> )	Baumwolle	
<i>Helianthus annuus</i>	Sonnenblume	
<i>Helianthus tuberosus</i>	Topinambur	
<i>Hevea brasiliensis</i>	Parakautschukbaum	60
<i>Hordeum vulgare</i>	Gerste	
<i>Humulus lupulus</i>	Hopfen	
<i>Ipomoea batatas</i>	Süßkartoffeln	
<i>Juglans regia</i>	Walnußbaum	
<i>Lactuca sativa</i>	Kopfsalat	65
<i>Lens culinaris</i>	Linse	
<i>Linum usitatissimum</i>	Faserlein	

	<i>Lycopersicon lycopersicum</i>	Tomate
	<i>Malus</i> spp.	Apfel
	<i>Manihot esculenta</i>	Maniok
5	<i>Medicago sativa</i>	Luzerne
	<i>Mentha piperita</i>	Pfefferminze
	<i>Musa</i> spp.	Obst- und Mehlbanane
	<i>Nicotiana tabacum</i> (N. rustica)	Tabak
	<i>Olea europaea</i>	Ölbaum
10	<i>Oryza sativa</i>	Reis
	<i>Panicum miliaceum</i>	Risphenhirse
	<i>Phaseolus lunatus</i>	Mondbohne
	<i>Phaseolus mungo</i>	Erbsenbohne
	<i>Phaseolus vulgaris</i>	Buschbohnen
15	<i>Pennisetum glaucum</i>	Perl- oder Rohrkolbenhirse
	<i>Petroselinum crispum</i> spp. tuberosum	Wurzelpetersilie
	<i>Picea abies</i>	Rotfichte
	<i>Abies alba</i>	Weißtanne
20	<i>Pinus</i> spp.	Kiefer
	<i>Pisum sativum</i>	Gartenerbse
	<i>Prunus avium</i>	Süßkirsche
	<i>Prunus domestica</i>	Pflaume
	<i>Prunus dulcis</i>	Mandelbaum
25	<i>Prunus persica</i>	Pfirsich
	<i>Pyrus communis</i>	Birne
	<i>Ribes sylvestre</i>	Rote Johannisbeere
	<i>Ribes uva-crispa</i>	Stachelbeere
30	<i>Ricinus communis</i>	Rizinus
	<i>Saccharum officinarum</i>	Zuckerrohr
	<i>Secale cereale</i>	Roggen
	<i>Sesamum indicum</i>	Sesam
	<i>Solanum tuberosum</i>	Kartoffel
35	<i>Sorghum bicolor</i> (s. vulgare)	Mohrenhirse
	<i>Sorghum dochna</i>	Zuckerhirse
	<i>Spinacia oleracea</i>	Spinat
	<i>Theobroma cacao</i>	Kakaobaum
40	<i>Trifolium pratense</i>	Rotklee
	<i>Triticum aestivum</i>	Weizen
	<i>Triticum durum</i>	Hartweizen
	<i>Vaccinium corymbosum</i>	Kulturheidelbeere
	<i>Vaccinium vitis-idaea</i>	Preißelbeere
45	<i>Vicia faba</i>	Pferdebohnen
	<i>Vigna sinensis</i> (V. unguiculata)	Kuhbohne
	<i>Vitis vinifera</i>	Weinrebe
	<i>Zea mays</i>	Mais

50

## Anwendungsbeispiele

Die herbizide Wirkung der 3H-Imidazo[4,5-h](Oxazolo[5,4-h])chinoline der Formel I auf das Wachstum der Testpflanzen wird durch folgende Gewächshausversuche gezeigt.

55 Als Kulturgefäße dienen Plastikblumentöpfe mit 300 cm<sup>3</sup> Inhalt und lehmigem Sand mit etwa 3,0% Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen werden nach Arten getrennt flach eingesät.

Zum Zwecke der Nachauflaufbehandlung werden entweder direkt gesäte oder in den gleichen Gefäßen aufgewachsene Pflanzen ausgewählt oder sie werden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt.

60 Je nach Wuchsform werden die Testpflanzen bei einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm dann mit den in Wasser als Verteilungsmittel suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen, die durch fein verteilende Düsen gespritzt werden, behandelt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung beträgt 1,0 kg Wirkstoff/ha.

Die Versuchsgefäße werden im Gewächshaus aufgestellt, wobei für wärmeliebende Arten wärmere Bereiche (20 bis 35°C) und für solche gemäßigtener Klimate 10 bis 20°C bevorzugt werden. Die Versuchsperiode erstreckt sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit werden die Pflanzen gepflegt und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wird ausgewertet.

65 Bewertet sind nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzen sich aus folgenden Arten zusammen:

Lateinischer Name	Deutscher Name
Cassia tora	—
Ipomoea spp.	Prunkwindenarten
Lamium amplexicaule	Stengelumfassende Taubnessel

5

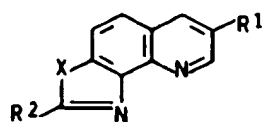
Bei einer Aufwandmenge von 1,0 kg Wirkstoff/ha lassen sich im Nachaufverfahren mit dem Wirkstoff Nr. 1 breitblättrige unerwünschte Pflanzen sehr gut bekämpfen, wobei der Wirkstoff gleichzeitig verträglich ist für die Kulturpflanze Mais.

10

### Patentansprüche

1. 3H-Imidazo[4,5h](Oxazolo[5,4h])chinoline der Formel

15



(I)

20

in der

R<sup>1</sup> für Wasserstoff, Halogen, Carboxyl oder gegebenenfalls durch Hydroxy, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkylthio oder Halogen substituiertes C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>-Alkyl,

25

R<sup>2</sup> für Wasserstoff, Halogen, Hydroxy, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkylthio, einen gegebenenfalls mit Halogen, Hydroxy, Acetoxy, Cyano, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkylthio substituierten C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>-Alkylrest, einen gegebenenfalls durch C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkyl substituierten C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>-Cycloalkylrest, einen gegebenenfalls durch Nitro, Amino, Halogen, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, Acylamino oder Acyloxy substituierten Benzyl-, Phenethyl-, Phenyl- oder Naphthylrest oder einen gegebenenfalls durch Nitro, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkyl oder Halogen substituierten 5- oder 6-gliedrigen heterocyclischen Ring mit einem oder zwei Heteroatomen, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel und Stickstoff und

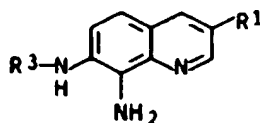
30

X für Sauerstoff oder den Rest N–R<sup>3</sup>, wobei R<sup>3</sup> Wasserstoff, gegebenenfalls durch Halogen, Amino, Mono- oder Dialkylamino, Hydroxy, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkylacyloxy substituiertes C<sub>1</sub>–C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>2</sub>–C<sub>6</sub>-Alkynyl, C<sub>3</sub>–C<sub>6</sub>-Cycloalkyl oder gegebenenfalls durch Halogen, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Halogenalkyl oder C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkoxy substituiertes Benzyl bedeutet, stehen.

35

2. Verfahren zur Herstellung von 3H-Imidazo[4,5-h]chinolinen der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man 7,8-Diaminochinolinen der Formel

40



(II)

45

in an sich bekannter Weise mit Carbonsäuren der Formel

R<sup>2</sup>–COOH (III)

50

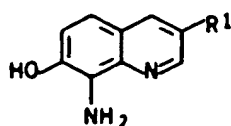
oder Orthoestern der Formel

R<sup>2</sup>C(OR<sup>4</sup>)<sub>3</sub> (IV)

55

in der R<sup>4</sup> C<sub>1</sub>–C<sub>4</sub>-Alkyl bedeutet, umsetzt.

3. Verfahren zur Herstellung von Oxazolo[5,4-h]chinolinen der Formel I gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man 7-Hydroxy-8-amino-chinoline der Formel



(V)

60

in an sich bekannter Weise mit Carbonsäuren der Formel

65

R<sup>2</sup>–COOH (III)

oder Orthoestern der Formel



in der  $R^4 C_1-C_4$ -Alkyl bedeutet, umsetzt.

4. Herbizid, enthaltend ein 3H-Imidazo[4,5-h](Oxazolo[5,4-h])chinolin der Formel I gemäß Anspruch 1.

5. Herbizid enthaltend inerte Zusatzstoffe und ein 3H-Imidazo[4,5-h](Oxazolo[5,4-h])chinolin der Formel I gemäß Anspruch 1.

6. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses, dadurch gekennzeichnet, daß man die Pflanzen und/oder ihren Standort mit einer herbizid wirksamen Menge eines 3H-Imidazo[4,5-h](Oxazolo[5,4-h])chinolins der Formel I gemäß Anspruch 1 behandelt.